

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
13. Januar 2005 (13.01.2005)

PCT

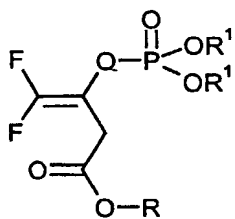
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/003077 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07C 69/716**, 67/30
- (21) Internationales Aktenzeichen: **PCT/EP2004/006607**
- (22) Internationales Anmeldedatum:
18. Juni 2004 (18.06.2004)
- (25) Einreichungssprache: **Deutsch**
- (26) Veröffentlichungssprache: **Deutsch**
- (30) Angaben zur Priorität:
10329450.3 1. Juli 2003 (01.07.2003) **DE**
10331496.2 11. Juli 2003 (11.07.2003) **DE**
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESSELLSCHAFT** [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **GALLENKAMP, Bernd** [DE/DE]; Paul-Ehrlich-Str. 13, 42113 Wuppertal (DE). **MULDER, Lubbertus** [NL/DE]; Auf dem Gellenkamp 44, 58135 Hagen (DE).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESSELLSCHAFT**; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): **AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.**
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): **ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).**

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

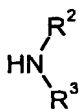
(54) Title: METHOD FOR PRODUCING DIFLUORO-ACETYL-ACETIC ACID ALKYLESTERS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUM HERSTELLEN VON DIFLUORACETESSIGSÄUREALKYLESTERN



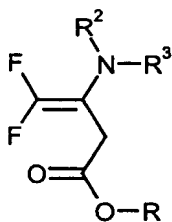
(IV)

(57) Abstract: The invention relates to a three-stage method for producing 4, 4-difluoro-acetyl-acetic acid alkylesters. In a first stage, a reaction of 4-chloro-4, 4-difluoro-acetyl-acetic acid alkylesters with trialkyl-phosphites of formula (III) $P(OR^1)_3$ is carried out, wherein R^1 is C_1 - C_4 alkyl, the R^1 groups can be identical or different for producing alkyl-phosphonic acid esters of formula (IV) which react with amine of formula (V) during a second stage, wherein R^2 and R^3 are hydrogen or C_1 - C_4 alkyl independent of each other, or jointly CH_2 - CH_2 -O- CH_2 - CH_2 - for forming enamines of formula (VI), wherein R^2 and R^3 have already mentioned significance, said enamines being hydrolysed in the presence of an acid during a third stage.



(V)

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft ein dreistufiges Verfahren zum Herstellen von 4,4-Di-fluor-acet-essig-säure-ethyl-ester, worin im ersten Schritt 4-Chlor-4,4-di-fluor-acet-essig-säure-ethyl-ester mit Trialkylphosphiten der Formel (III) $P(OR^1)_3$ in welcher R^1 für C_1 - C_4 -Alkyl steht, wobei die Reste R^1 jeweils gleich oder verschieden sein können, zu Alkylphosphonsäureestern der Formel (IV) umgesetzt wird, welche im zweiten Schritt mit einem Amin der Formel (V) in welcher R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl oder gemeinsam für $-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$ stehen, zu Enaminen der Formel (VI) in welcher R^2 und R^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt werden, welche im dritten Schritt in Gegenwart einer Säure hydrolysiert werden.



(VI)

WO 2005/003077 A1



Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.